

## PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 2002-363097

(43)Date of publication of application : 18.12.2002

(51)Int.Cl.

A61K 38/00  
A61K 9/19  
A61K 47/04  
A61K 47/36  
A61P 31/10  
A61P 33/08  
// C07K 7/54

(21)Application number : 2001-312701

(71)Applicant : FUJISAWA PHARMACEUT CO LTD

(22)Date of filing : 29.06.2000

(72)Inventor : SAWAI SEIJI  
KASAI AKIHIRO  
OTOMO KAZUMI

(30)Priority

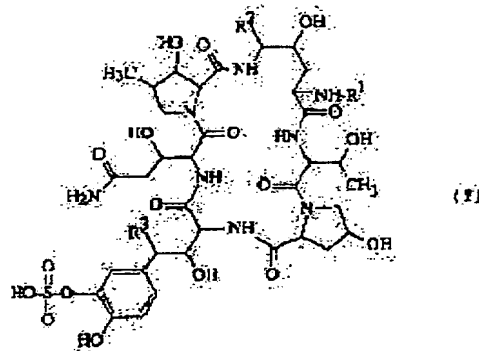
Priority number : 11187713 Priority date : 01.07.1999 Priority country : JP

### (54) STABILIZED AND LYOPHILIZED TYPE PHARMACEUTICAL COMPOSITION

(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a stabilized and lyophilized type pharmaceutical composition containing a cyclic polypeptide compound effective for Eumycetes causing several kinds of infectious diseases.

SOLUTION: This stabilized and lyophilized type pharmaceutical composition comprises a cyclic polypeptide of formula (I): [wherein R1 is H or an acryl; R2 and R3 are each same or differently H or hydrox] or a pharmaceutically permissible salt thereof as the active ingredient and at least one suitable stabilizer selected from the group consisting of polysaccharides, disaccharides and sodium chloride.



### LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

BEST AVAILABLE COPY

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision  
of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's  
decision of rejection]

[Date of extinction of right]

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号  
特開2002-363097  
(P2002-363097A)

(43) 公開日 平成14年12月18日 (2002.12.18)

(51) Int.Cl. <sup>7</sup>	識別記号	F I	マークシート(参考)
A 6 1 K 38/00		A 6 1 K 9/19	
9/19		47/04	
47/04		47/36	
47/36		A 6 1 P 31/10	
A 6 1 P 31/10		33/08	
審査請求 未請求 請求項の数 9 O L (全 12 頁) 最終頁に続く			

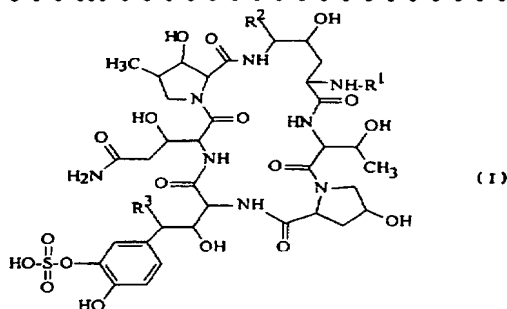
(21) 出願番号 特願2001-312701(P2001-312701)  
(62) 分割の表示 特願2001-507492(P2001-507492) の  
分割  
(22) 出願日 平成12年6月29日(2000.6.29)  
(31) 優先権主張番号 特願平11-187713  
(32) 優先日 平成11年7月1日(1999.7.1)  
(33) 優先権主張国 日本 (J P)

(71) 出願人 000005245  
藤沢薬品工業株式会社  
大阪府大阪市中央区道修町3丁目4番7号  
(72) 発明者 澤居 清治  
兵庫県宝塚市社町5-3-104  
(74) 代理人 100065248  
弁理士 野河 信太郎

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 安定化された凍結乾燥型医薬組成物

.....  
.....  
.....  
.....  
.....

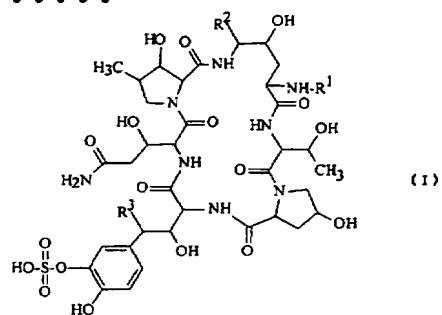


.....  
.....  
.....  
.....

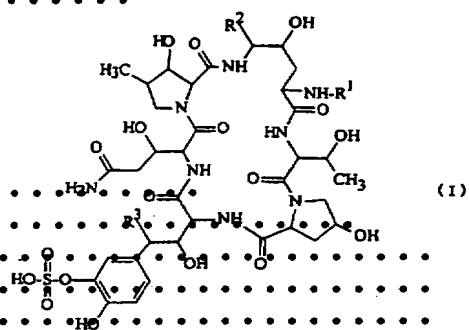
(2)

1

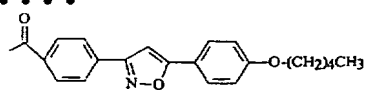
2



10



20

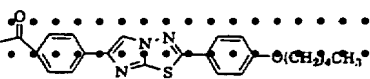
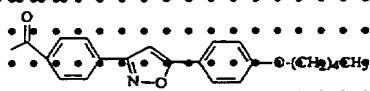


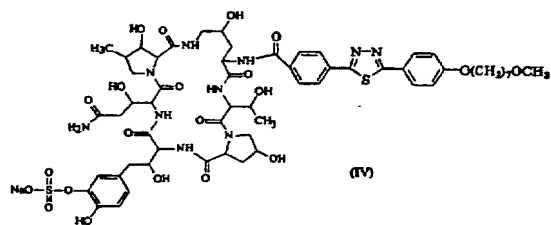
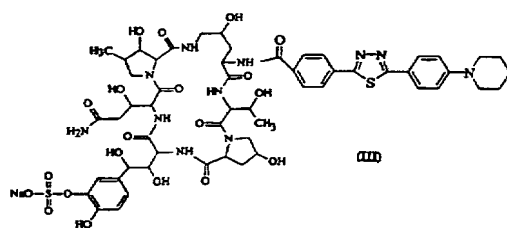
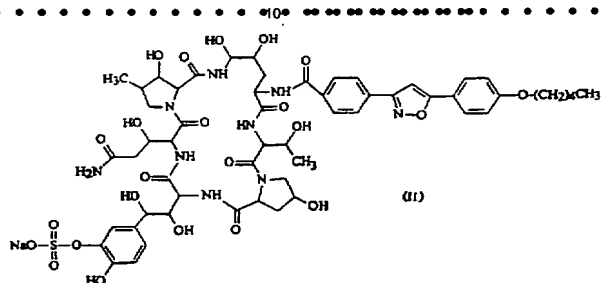
30

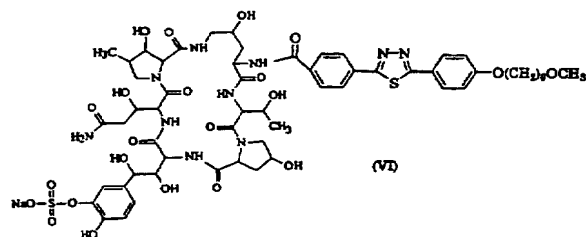
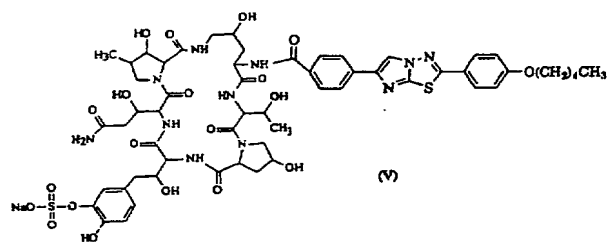
40

50

50









12

50

安定化剤	試験項目	0 時間	9 日後
対照： なし	外見	白色塊	わずかに黄色塊
	pH *	7.1	2.7
	残存量 (%)	100.0	8.0
	水分含量 (%)	1.3	-
乳糖 (100 mg)	外見	白色塊	白色塊
	pH *	6.4	6.1
	残存量 (%)	100.0	99.5
	水分含量 (%)	1.0	-
塩化ナトリウム (9 mg)	外見	白色塊	白色塊
	pH *	6.7	6.3
	残存量 (%)	100.0	75.9
	水分含量 (%)	0.7	-

\* 1ml の水中の組成物の再溶解溶液の pH

安定化剤	試験項目	0 時間	9 日後
対照：なし	外見	白色塊	白色塊
	pH *	6.8	5.4
	残存量 (%)	100.0	<75.0
	水分含量 (%)	3.3	-
マルトース (100 mg)	外見	白色塊	白色塊
	pH *	7.3	6.7
	残存量 (%)	100.0	98.6
	水分含量 (%)	0.9	-
ショ糖 (50 mg)	外見	白色塊	白色溶解物
	pH *	6.9	7.0
	残存量 (%)	100.0	82.4
	水分含量 (%)	1.1	-
グルコース (50 mg)	外見	白色溶解物	茶色溶解物
	pH *	6.9	3.6
	残存量 (%)	100	1.1
	水分含量 (%)	4.3	-

\* 1ml の水中の組成物の再溶解溶液の pH

添加した乳糖の量 (mg)	試験項目	〇 時間	70℃で9日後	40℃、75%湿度で3ヶ月後
20	外見	白色塊	わずかに黄色塊	白色塊
	色 *	無色	白色	無色
	透明性 *	透明	不透明	透明
	pH *	6.09	3.03	6.57
	残存量 (%)	100.0	88.09	100.0
	全不純物含量 (%)	3.44	12.3	3.99
	水分含量 (%)	1.2	-	-
50	外見	白色塊	白色塊	白色塊
	色 *	無色	無色	無色
	透明性 *	透明	透明	透明
	pH *	6.57	5.56	6.26
	残存量 (%)	100.0	96.7	99.8
	全不純物含量 (%)	3.32	7.37	4.21
	水分含量 (%)	0.5	-	-
100	外見	白色塊	白色塊	白色塊
	色 *	無色	無色	無色
	透明性 *	透明	透明	透明
	pH *	6.58	6.08	5.80
	残存量 (%)	100.0	96.7	99.6
	全不純物含量 (%)	3.43	7.08	3.96
	水分含量 (%)	0.3	-	-
200	外見	白色塊	白色塊	白色塊
	色 *	無色	無色	無色
	透明性 *	透明	透明	透明
	pH *	6.78	5.70	5.36
	残存量 (%)	100.0	96.1	99.6
	全不純物含量 (%)	3.40	7.30	4.35
	水分含量 (%)	0.3	-	-

\* 色、透明性および 1ml の水中の組成物の再溶解溶液の pH

・精製水 5ml 中の組成物の再溶解溶液の pH

\* 精製水 5ml 中の組成物の再溶解溶液の pH

0 時間における水分含量(%)		0.9	1.4	2.6	3.4	5.1
0 時間	pH*	7.1				
9 日後	pH*	7.5	7.1	6.8	6.8	3.5
	水分含量 (%)	2.5	2.9	3.6	4.3	5.4
	残存量 (%)	97.6	98.1	97.1	92.7	18.3

\* 1ml の水中の組成物の再溶解溶液の pH

.....

.....

....

.....

.....

.....

....

.....

.....

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☐ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**